

特許協力条約

発信人 日本国特許庁（国際調査機関）

出願人代理人

岸田 正行

様

あて名

〒 100-0005

東京都千代田区丸の内 2-6-2
丸の内八重洲ビル424号

P C T

国際調査機関の見解書

〔法施行規則第40条の2〕

〔P C T規則43の2.1〕

発送日
(日.月.年)

29.03.2005

出願人又は代理人

の書類記号 F P O 3 2 7 P C T

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号
P C T / J P 2 0 0 5 / 0 0 2 3 8 9

国際出願日

(日.月.年) 17.02.2005

優先日

(日.月.年) 18.02.2004

国際特許分類 (I P C) Int. Cl' C07D207/16, 403/12, 401/12, 417/12, 401/14, 405/12, 417/14, 409/12, 413/12, A61K31/4192, 3
1/427, 31/4439, 31/65, 31/428, 31/433, 31/4245, 31/4025, 31/454, 31/496, 31/5377 (補充欄に続く)

出願人（氏名又は名称）

杏林製薬株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

- 第I欄 見解の基礎
 第II欄 優先権
 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
 第IV欄 発明の単一性の欠如
 第V欄 P C T規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
 第VI欄 ある種の引用文献
 第VII欄 国際出願の不備
 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がP C T規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式P C T / I S A / 2 2 0を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式P C T / I S A / 2 2 0を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式P C T / I S A / 2 2 0の備考を参照すること。

見解書を作成した日

11.03.2005

名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）

安藤 倫世

4 P 9837

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

第 I 欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎として作成された。

この見解書は、_____語による翻訳文を基礎として作成した。
それは国際調査のために提出された PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう翻訳文の言語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列について、
以下に基づき見解書を作成した。

- a. タイプ 配列表
 配列表に関連するテーブル
- b. フォーマット 表面
 コンピュータ読み取り可能な形式
- c. 提出時期 出願時の国際出願に含まれる
 この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された
 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 指定意見：

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 1 - 8 請求の範囲 _____	有無
進歩性 (I S)	請求の範囲 _____ 請求の範囲 1 - 8	有無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 1 - 8 請求の範囲 _____	有無

2. 文献及び説明

- 文献 1 : US 2002/193390 A1 (NOVARTIS A.-G.) 2002.12.19
 文献 2 : JP 2003-520849 A (ノボ・ノルディスク アクティゼルスカブ) 2003.07.08
 文献 3 : JP 2002-356472 A (田辺製薬株式会社) 2002.12.13
 文献 4 : JP 2004-503531 A (ノボ・ノルディスク アクチング・セラピューツ) 2004.02.05
 文献 5 : JP 2004-002368 A (田辺製薬株式会社) 2004.01.08
 文献 6 : JP 2004-002367 A (田辺製薬株式会社) 2004.01.08
 文献 7 : WO 2004/009544 A1 (山之内製薬株式会社) 2004.01.29
 文献 8 : WO 2003/106456 A2 (SANOFI-SYNTHELABO) 2003.12.24 & WO 2003/106456 A3

[1] 請求の範囲 1 - 8 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1 及び 2 と、3 - 8 とにより進歩性を有しない。

文献 1 には、DPP-I V 阻害活性を有する化合物として、1-[(4-ペンチルビシクロ[2.2.2]オクター-1-イル)アミノ]アセチル]-2-シアノ-(S)-ピロリジンが記載されており、請求の範囲 1 - 6 に記載された発明は、これとは、ビシクロ[2.2.2]オクタン環の 4 位置換基がペンチル基である点で相違している（第 14 頁【0187】欄参照）。

また、文献 2 には、DPP-I V 阻害活性を有し、N(置換グリシル)-2-シアノピロリジン骨格にビシクロ[2.2.2]オクタン環を有する化合物として、(S, S)-1-(2-アミノ-2-ビシクロ[2.2.2]オクトー-1-イルアセチル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-カルボニトリルが記載されている（第 32 頁参照）。

一方、文献 3 - 8 に記載されるように、DPP-I V 阻害活性を有する N(シクロアルカン置換グリシル)-2-シアノピロリジンとして、シクロアルカンあるいは複素環の、4 位（又はパラ位）にアミド基を有する化合物は種々知られている（文献 3 第 48-62 頁、第 64-68 頁、第 70 頁、第 72-73 頁、第 87-103 頁、文献 4 第 35 頁 J, K、文献 5 第 18-20 頁、文献 6 第 56, 77 頁、文献 7 第 29 頁 No. 23, 28、第 30 頁 No. 30, 32, 38、文献 8 第 34 頁 No. 39 参照）。

そうしてみると、文献 1 に記載のビシクロ[2.2.2]オクタン環の 4 位の置換基として、アミド基を有する化合物を想到することは、当業者が容易に行い得ることである。

また、文献 1 - 7 には、これらのアミノ基を保護した中間体を経ることについても記載されている（文献 1 第 15 頁、文献 2 第 59 頁、文献 3 第 10 頁、文献 4 第 17 頁、文献 5 第 36-45 頁、文献 6 第 39-47 頁、文献 7 第 11-12 頁 参照）。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き**国際特許分類 (IPC) の続き**

Int. Cl' A61P3/10, 7/00, 7/10, 9/12, 13/08, 17/06, 19/02, 19/10, 25/28, 29/00,
31/04, 31/18, 35/04, 37/06, 37/08, 43/00